

Abstract

The present invention provides a process for preparing 2-amino-4-chloro-6-alkoxypyrimidines by reacting the 2-amino-4,6-dichloropyrimidine with an alkali metal alkoxide or a mixture of alkali metal hydroxides and an alcohol, in which the reaction is effected in a polar aprotic solvent (or solvent mixture), the solvent is subsequently distilled off to an extent of >30% and the product is precipitated by adding water during or after the distillation. This process, in which the polar aprotic solvent used may in particular be acetone and which can be performed at temperatures between 5 and 60°C, allows 2-amino-4-chloro-6-alkoxypyrimidines and in particular 2-amino-4-chloro-6-methoxypyrimidine to be prepared in high yields and at simultaneously very marked purity in a particularly economically viable and environmentally benign manner.

(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES
PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum
Internationales Büro(43) Internationales Veröffentlichungsdatum
6. Mai 2004 (06.05.2004)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 2004/037795 A1(51) Internationale Patentklassifikation⁷: C07D 239/46

Trostberg (DE). MOSER, Wolfgang [DE/DE]; Carosiedlung 2, 83308 Trostberg (DE). KRAMMER, Doris [DE/DE]; Mühlweg 6, 83376 Truchtlaching (DE).

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2003/011844

(22) Internationales Anmeldedatum:
24. Oktober 2003 (24.10.2003)

(74) Anwälte: WEICKMANN, Franz, Albert usw.; Weickmann & Weickmann, Postfach 860 820, 81635 München (DE).

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(81) Bestimmungsstaaten (national): JP, US.

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(84) Bestimmungsstaaten (regional): europäisches Patent (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PT, RO, SE, SI, SK, TR).

(30) Angaben zur Priorität:
102 49 946.2 26. Oktober 2002 (26.10.2002) DE

Veröffentlicht:

- mit internationalem Recherchenbericht
- vor Ablauf der für Änderungen der Ansprüche geltenden Frist; Veröffentlichung wird wiederholt, falls Änderungen eintreffen

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von US): DEGUSSA AG [DE/DE]; Dr.-Albert-Frank-Strasse 32, 83308 Trostberg (DE).

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): HUBER, Sylvia [DE/DE]; Jägerweg 11, 83308 Trostberg (DE). GÜTHNER, Thomas [DE/DE]; Graf-Rapoto-Strasse 2, 83308

Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen Abkürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Codes and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der PCT-Gazette verwiesen.

(54) Title: METHOD FOR THE PRODUCTION OF 2-AMINO-4-CHLORO-6-ALKOXYPYRIMIDINES

(54) Bezeichnung: VERFAHREN ZUR HERSTELLUNG VON 2-AMINO-4-CHLOR-6-ALKOXYPYRIMIDINEN

(57) Abstract: The invention relates to a method for producing 2-amino-4-chloro-6-alkoxy-pyrimidines by reacting 2-amino-4,6-dichloropyrimidine with an alkali alcoholate or a mixture of alkali hydroxides and an alcohol in a polar aprotic solvent (mixture), whereupon the solvent is distilled off to > 30 percent and the product is precipitated by adding water during or following the distillation process. The inventive method, in which especially acetone is used as a polar aprotic solvent and which can be carried out at temperatures between 5 and 60 °C, allows 2-amino-4-chloro-6-alkoxy-pyrimidines and above all 2-amino-4-chloro-6-methoxy-pyrimidine to be produced in a particularly economical and environmentally friendly manner while obtaining high yields and a very distinctive purity.

(57) Zusammenfassung: Gegenstand der vorliegenden Erfindung ist ein Verfahren zur Herstellung von 2-Amino-4-chlor-6-alkoxy-pyrimidinen durch Umsetzung des 2-Amino-4,6-dichloropyrimidins mit einem Alkalialkoholat oder einem Gemisch von Alkalihydroxiden und einem Alkohol, bei dem die Umsetzung in einem polaren aprotischen Lösemittel(-gemisch) erfolgt, das Lösemittel anschliessend zu >30% abdestilliert und das Produkt durch Zugabe von Wasser während oder nach der Destillation ausgefällt wird. Mit diesem Verfahren, bei dem als polares aprotisches Lösemittel insbesondere Aceton eingesetzt wird und das bei Temperaturen zwischen 5 und 60 °C ausgeführt werden kann, lassen sich 2-Amino-4-chlor-6-alkoxy-pyrimidine und vor allem das 2-Amino-4-chlor-6-methoxy-pyrimidin auf besonders wirtschaftliche und umweltschonende Weise in hohen Ausbeuten und bei gleichzeitig sehr ausgeprägter Reinheit herstellen.

WO 2004/037795 A1